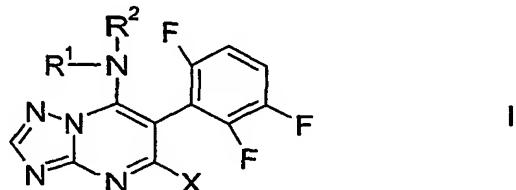


**6-(2, 3, 6-TRIFLUORPHENYL) -TRIAZOLOPYRIMIDINE ZUR  
BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN**

**Beschreibung**

Die vorliegende Erfindung betrifft 6-(2,3,6-Trifluorphenyl)-triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocycus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R<sup>2</sup> Wasserstoff oder eine der bei R<sup>1</sup> genannten Gruppen,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> tragen:

R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocycus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, ali-

## 2

cyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

- X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder  
5 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy.

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

10 5-Halogen-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-triazolopyrimidine sind aus EP-A 945 453 allgemein bekannt. 5-Cyano- und 5-Alkoxy-triazolopyrimidine sind in WO 02/083677 offenbart. Triazolopyrimidine mit optisch aktiven Aminosubstituenten in 7-Position werden in WO 02/38565 allgemein vorgeschlagen.

15 Die in den vorgenannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignet.

Ihre Wirkung ist jedoch nicht immer in jeder Hinsicht völlig zufriedenstellend. Davon  
20 ausgehend liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des Weiteren wurde ein Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur  
25 Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

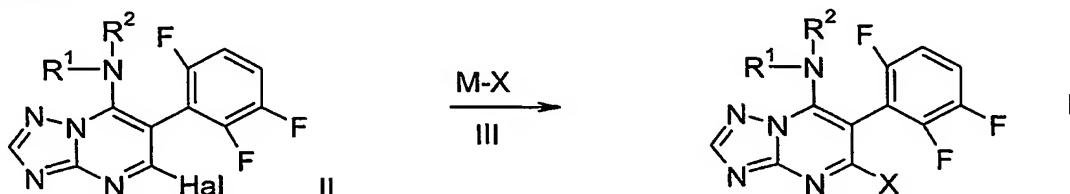
Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in der vorgenannten Schrift beschriebenen durch die Substitution in der 5-Position des Triazolopyrimidin-Gerüstes.

30 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit, bzw. ein verbreitertes Wirkungsspektrum gegen Schadpilze auf.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten  
35 werden. Vorteilhaft werden sie ausgehend von den aus EP-A 945 453 bekannten 5-Halogen-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II durch Umsetzung mit Verbindungen M-X (Formel III) erhalten. Verbindungen III stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels.  
40 Das Kation M in Formel III hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind übli-

3

cherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.

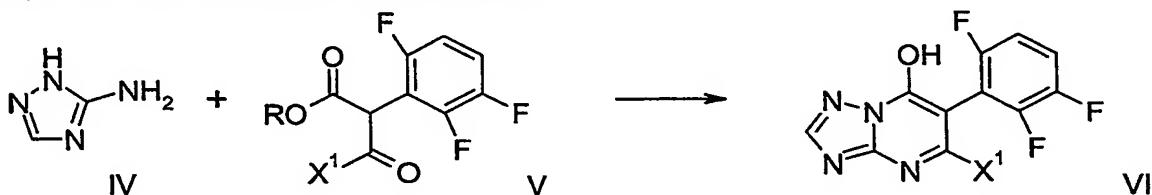


Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C  
[vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Sofern R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet, wird vorteilhaft vor Umsetzung mit III eine abspaltbare Schutzgruppe eingeführt [vgl. Greene, Protective Groups in Organic Chemistry, J. Wiley & Sons, (1981)].

10 Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, Alkohole, wie Methanol oder Ethanol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol oder Acetonitril.

15 Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:

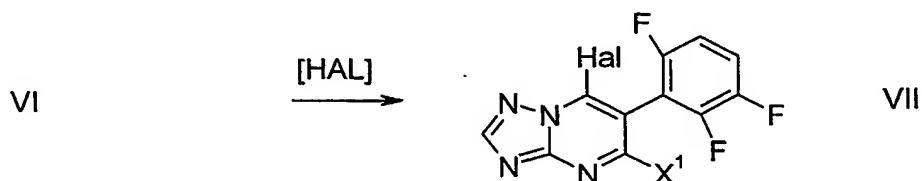


Ausgehend von 2-Aminotriazol IV und Ketoestern V, wobei R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VI erhalten. In Formeln V und VI steht X<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (V mit X<sup>1</sup>=CH<sub>3</sub>) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten, die einen bevorzugten Gegenstand der Erfindung darstellen [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. 2-Aminotriazol IV ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen V erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschrieben Bedingungen.

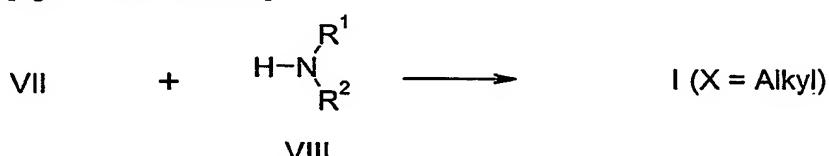
Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungs-mitteln [HAL] unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Halogenpyrimidine der Formel VII überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungs-mittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoro-

4

xybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt.



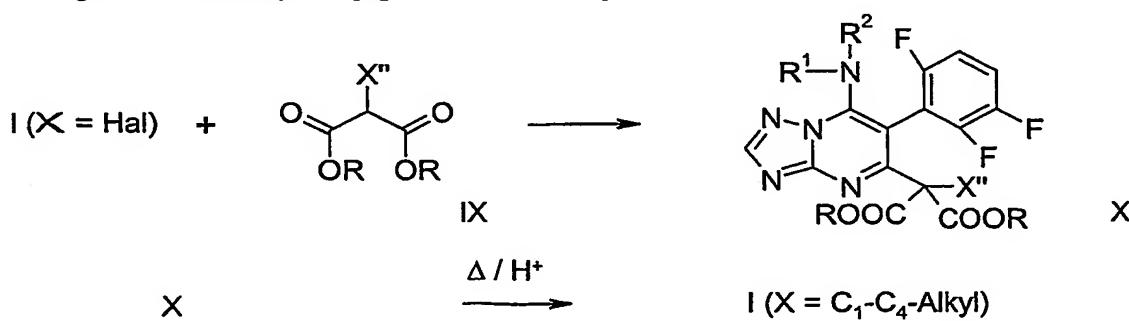
Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C,  
durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].



Die Umsetzung von VII mit Aminen VIII, wobei R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> wie in Formel I definiert sind, wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VIII kann als Base dienen.

Verbindungen der Formel I, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel IX hergestellt werden. In Formel IX bedeuten X" Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl und R C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel X umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].



Die Malonate IX sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

## 5

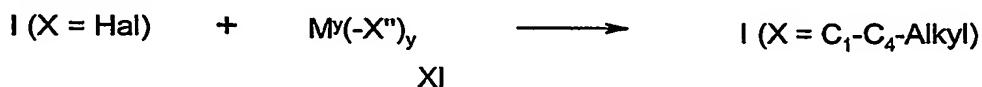
Die anschließende Verseifung des Esters X erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen X vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

5

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- 10 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 15
- 20

Verbindungen der Formel I, in denen X für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht, können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit metallorganischen Reagenzien der Formel XI erhalten werden. In einer Ausführungsform dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



In Formel XI steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

30  
35 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter verminderter Druck und bei mäßig er-

## 6

höhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

- 5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine  
10 Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

15 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

20 Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 25 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

30 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlor-methyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, 35 Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluo-rethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

40 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger

Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-buteneyl, 3-Methyl-1-buteneyl, 1-Methyl-2-buteneyl, 2-Methyl-2-

- 5 butenyl, 3-Methyl-2-buteneyl, 1-Methyl-3-buteneyl, 2-Methyl-3-buteneyl, 3-Methyl-3-buteneyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-
- 10 pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-buteneyl, 1,1-Dimethyl-3-buteneyl, 1,2-Dimethyl-1-buteneyl, 1,2-Dimethyl-2-buteneyl, 1,2-Dimethyl-3-buteneyl, 1,3-Dimethyl-1-buteneyl, 1,3-Dimethyl-2-buteneyl, 1,3-Dimethyl-3-buteneyl, 2,2-Dimethyl-3-buteneyl, 2,3-Dimethyl-1-buteneyl, 2,3-Dimethyl-2-buteneyl, 2,3-Dimethyl-3-buteneyl, 3,3-Dimethyl-1-buteneyl, 3,3-Dimethyl-2-buteneyl, 1-Ethyl-1-buteneyl, 1-Ethyl-2-buteneyl, 1-Ethyl-3-buteneyl, 2-Ethyl-1-buteneyl, 2-Ethyl-2-buteneyl, 2-Ethyl-3-buteneyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 15 Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;
- 20 25 Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-1-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- 30 Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;
- 35

fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

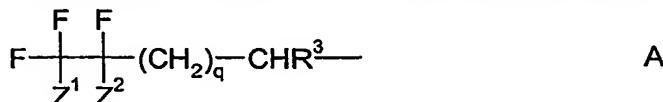
- 5- oder 6-gliedriges Heterocycl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome
- 5 und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoazolidinyl, 4-Isoazolidinyl, 5-Isoazolidinyl, 3-Iothiazolidinyl, 4-Iothiazolidinyl, 5-Iothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyran, 4-Tetrahydropyran, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 15
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 20
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- 25
- 30 Alkylen: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, welche über eine Doppelbindung an das Gerüst gebunden sind, z. B. =CH<sub>2</sub>, =CH-CH<sub>3</sub>, =CH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;
- 35

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

- 5 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für eine Gruppe A steht:



- 10 worin

Z<sup>1</sup> Wasserstoff, Fluor oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Fluoroalkyl,

Z<sup>2</sup> Wasserstoff oder Fluor, oder

Z<sup>1</sup> und Z<sup>2</sup> bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

- 15 q 0 oder 1 ist; und

R<sup>3</sup> Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl steht, welches durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

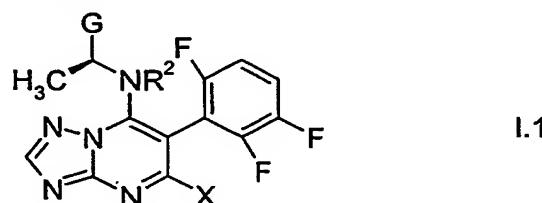
- 20 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>2</sup> Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

Sofern R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitäts-

- 25 zentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R<sup>1</sup> oder R<sup>2</sup> sind die (R)- konfigurierten Isomeren bevorzugt.

Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



- 30

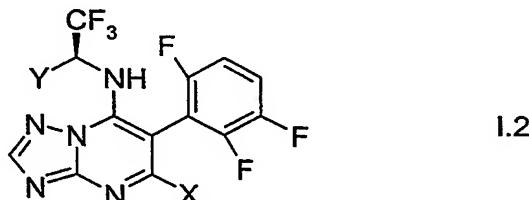
in der

G C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl, insbesondere Ethoxymethyl, oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

10

- R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; und  
 X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

- 5 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.2.



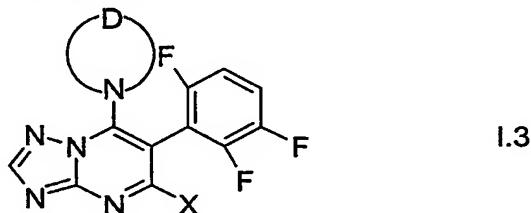
in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere für Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

10

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten

15

und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.3,



20 in der

- D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann; und  
 X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

30

## 11

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidinyl-, Morphinyl- oder Thiomorpholinylring bilden, insbesondere einen Piperidinylring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiert ist. Besonders be-

- 5 vorzugt sind die Verbindungen, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazol-

- 10 ring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen

- 15 R<sup>1</sup>CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R<sup>2</sup> Wasserstoff oder Methyl; oder R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- bedeuten.

- 20 Weiterhin werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X Cyano, Methoxy oder Ethoxy, insbesondere Cyano oder Methoxy bedeutet.

In einer anderen bevorzugten Ausgestaltung der Verbindungen der Formel I bedeutet X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl.

- 25 Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

#### Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

- 35
- #### Tabelle 2
- Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## 5 Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl bedeutet und die Kombination von R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

## Tabelle A

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-1	CH <sub>3</sub>	H
A-2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-3	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-5	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-6	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-7	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-8	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-9	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
A-10	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-11	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-12	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-15	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-18	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-19	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-20	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-24	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-25	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-26	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-27	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-28	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-29	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-30	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
A-31	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-32	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-33	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-34	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-35	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-36	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-37	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-38	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-39	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
A-40	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-42	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-43	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-44	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-45	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-46	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-47	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-48	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
A-49	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-50	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-51	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-52	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-53	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-54	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-55	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-56	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-57	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
A-58	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-59	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-60	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-61	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-62	(±) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-63	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-64	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-65	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-66	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
A-67	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-68	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-69	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-70	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-71	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-72	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
A-73	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
A-74	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-75	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H
A-76	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-77	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-78	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H
A-79	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
A-80	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-81	CH <sub>2</sub> -C≡CH	H
A-82	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>3</sub>
A-83	CH <sub>2</sub> -C≡CH	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-84	Cyclopentyl	H
A-85	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>
A-86	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-87	Cyclohexyl	H
A-88	Cyclohexyl	CH <sub>3</sub>
A-89	Cyclohexyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-90	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H
A-91	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
A-92	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
A-93	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -	
A-94	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	
A-95	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-96	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CHFCH <sub>2</sub> -	
A-97	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-98	-CH <sub>2</sub> CHF(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	
A-99	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-100	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-101	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> S(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
A-102	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
A-103		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-104		-CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -
A-105		-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
A-106		-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-107		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-
A-108		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-109		-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
A-110		-(CH <sub>2</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -
A-111		-CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
A-112		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-113		-(CH <sub>2</sub> )-CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-114		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -
A-115		-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
A-116		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
A-117		-N=CH-CH=CH-
A-118		-N=C(CH <sub>3</sub> )-CH=C(CH <sub>3</sub> )-
A-119		-N=C(CF <sub>3</sub> )-CH=C(CF <sub>3</sub> )-

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- 15 • *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- 20 • *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,

## 16

- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
  - *Plasmopara viticola* an Reben,
  - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
  - *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 5     • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
  - *Pyricularia oryzae* an Reis,
  - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
  - *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 10    • *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
  - *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid

20    wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

25    Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis

30    1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g je 100 Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise

35    0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem

Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des

5 Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure,

20 Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykolether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Tristerylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

25

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

30

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

35

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein,

- 5 Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

10

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

15

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

- 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem 20 wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

- 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter 25 Zusatz eines Dispergiermittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

- 15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von 30 Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

- 40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von 35 Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

40

**E Suspensionen (SC, OD)**

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

**F Wasserdispergierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)**

5 50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, 10 Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispergierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

**G Wasserdispergierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)**

15 75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

**20 2. Produkte für die Direktapplikation****H Stäube (DP)**

5 5 Gew. Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

**I Granulate (GR, FG, GG, MG)**

25 0.5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtröcknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

**J ULV- Lösungen (UL)**

10 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln,

40 Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder

Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

- 5 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber  
10 auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

- 15 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

- 20 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

- 25 Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

- 30 Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.
- 35 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:
  - Acylalanine wie Benalaxyd, Metalaxyd, Ofurace, Oxadixyl,

- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
  - Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
  - Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder Streptomycin,
- 5            • Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 10            • Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
  - Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
  - Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,
- 15            • Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenoxy, Pyroquilon, Quinoxyfen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
  - 20            • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
  - Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
  - Schwefel
  - Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Dicloromezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone, Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- 25            • Strobilurine wie Azoxyxstrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 30            • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluanid, Folpet, Tolyfluanid
  - Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

#### Synthesebeispiele

- 35 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

## 22

Beispiel 1: Herstellung von 5-Cyano-6-(2,3,6-trifluor-phenyl)-7-(2-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 0,2 g (0,5 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluor-phenyl)-7-(2-

- 5 methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP-A 945 453] und 0,5 g (3,3 mmol) Tetrabutylammoniumcyanid in 2 ml Acetonitril wurden 14 Std. bei 20-25°C gerührt. Anschließend dampfte man die Reaktionsmischung im Vakuum ein und reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril/Wasser-Gemischen. Aus dem Eluat erhielt man 0,13 g der Titelverbindung als farblosen Festkörper vom Fp 173-177°C.

10  
15  
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 4,65 (m, 1H); 3,1-3,4 (m, 2H); 1,8-1,9 (m, 1H); 1,6-1,8 (m, 3H); 1,5 (m, 2H); 1,25 (m, 3H).

20  
25  
Beispiel 2: Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-cyclopentylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 0,2 g (0,5 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluor phenyl)-7-cyclopentylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP 945 453] in 5 ml Methanol wurde nach Zusatz von

- 20 0,12 g 30 %iger Natrium-methanolat-Lsg. 24 Std. bei 20-25°C, dann 3 Std. bei 50°C gerührt, nach Zugabe weiterer 0,12 g 30 % iger Natrium-methanolat-Lsg. 8 Std. bei 50 °C, nach erneuter Zugabe von 0,2 g 30 % ige Natrium-methanolat-Lsg. 4 Std. bei 60°C, dann 18 Std. bei 20-25°C gerührt. Anschließend dampfte man die Reaktionsmischung im Vakuum ein und reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril-Wasser-Gemischen. Aus dem Eluat erhielt man 0,13 g der Titelverbindung als gelbes Harz.

30  
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, δ in ppm): 8,2 (s, 1H); 7,3 (m, 1H); 6,95 (m, 1H); 6,2 (d, 1H); 4,0 (s, 3H); 3,55 (m, 1H); 1,65 (m, 4H); 1,5 (m, 4H)

Beispiel 3: Herstellung von 5-Methyl-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-(2-methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

Eine Lösung von 0,6 g (1,6 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-(2-

- 35 methylpiperidinyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP 945 453] und 0,6 g (4 mmol) Natrium-dimethylmalonat in 5 ml Acetonitril wurde ca. 5 Std. bei 80°C gerührt. Dabei fiel ein gelber Festkörper aus. Anschließend saugte man die Reaktionsmischung über Kieselgur ab, nahm den gelben Festkörper in Methylenechlorid und verdünnter Salzsäure auf und rührte die Suspension ca. 15 min bei 20-25°C. Dann wurden die Phasen getrennt, die organische Phase wurde getrocknet und vom Lösungsmittel befreit.

Der erhaltene Rückstand wurde – ohne Reinigung – in 10 ml konz. Salzsäure aufgenommen und die Reaktionsmischung wurde 3 Std. bei 80-90°C gerührt. Dann verdünnte man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahierte die wässrige Phase mit

- 5 Methylchlorid. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Man reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril-Wasser-Gemischen und Digerieren in Hexan. Man erhielt 0,2 g der Titelverbindung als hellen Festkörper vom Fp 108-110°C.
- 10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  in ppm): 8,4 (s, 1H); 7,3 (m, 1H); 7,0 (m, 1H); 4,2 (m, 1H); 3,05-3,25 (m, 2H); 2,4 (s, 3H); 1,25-1,75 (m, 6H); 1,05 (m, 3H)

Tabelle I - Verbindungen der Formel I:

Nr.	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	X	Phys. Daten Fp [°C]
I-1	2-Methylpiperidinyl		-CN	173-177
I-2	Cyclopentyl	H	-OCH <sub>3</sub>	(s. Bsp. 2)
I-3	2-Methylpiperidinyl		-CH <sub>3</sub>	108-110
I-4	Cyclopentyl	H	-CN	130-145

15

#### Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

20

Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 25 mg Wirkstoff, welcher mit einem Gemisch aus Aceton und/oder DMSO und dem Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenoole) im Volumen-Verhältnis Lösungsmittel-Emulgator von 99 zu 1 ad 10 ml aufgefüllt

25 wurde. Anschließend wurde ad 100 ml mit Wasser aufgefüllt. Diese Stammlösung wurde mit dem beschriebenen Lösungsmittel-Emulgator-Wasser Gemisch zu der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration verdünnt.

30

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres* bei protektiver Anwendung

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte "Hanna" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die

35

Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn.]

*Drechslera] teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inkuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

5

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, bzw. I-4 behandelten Pflanzen nicht über 7 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

- 10 Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

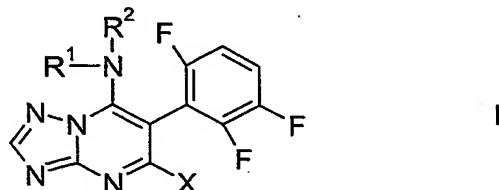
Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen

- 15 Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die  $1,7 \times 10^6$  Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomalzlösung enthielt, inkuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den  
20 Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, bzw. I-4 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

## Patentansprüche

### 1. 6-(2,3,6-Trifluorophenyl)-triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

**R<sup>1</sup>** C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S.

10 Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

$R^2$  Wasserstoff oder eine der bei  $R'$  genannten Gruppen,

15 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann;

20

25 R<sup>1</sup> und/oder R<sup>2</sup> können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R<sup>a</sup> tragen:

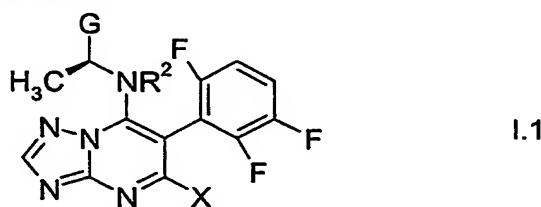
30 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
 alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-  
 Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy,  
 Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf-  
 oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromati-  
 scher Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der  
 Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder

35

## 26

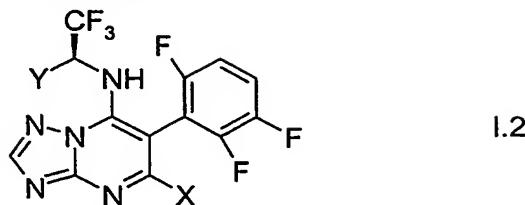
aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

- 5            X      Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy.
- 10          2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyloxy bedeutet.
- 15          3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Cyano bedeutet.
- 20          4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Methyl bedeutet.
- 25          5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Methoxy bedeutet.
- 30          6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> folgende Bedeutung haben:
- 20          R<sup>1</sup>     CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, Cyclopentyl, Cyclohexyl;
- 25          R<sup>2</sup>     Wasserstoff oder Methyl; oder
- 30          R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> bilden gemeinsam -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH(CF<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.
- 35          7. Verbindungen der Formel I.1:



- 30          in der
- G      C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxymethyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;
- R<sup>2</sup>    Wasserstoff oder Methyl; und
- X      Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

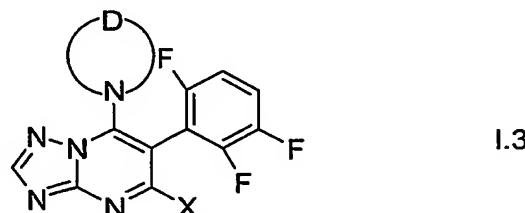
## 8. Verbindungen der Formel I.2.



in der Y für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und X für Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

5

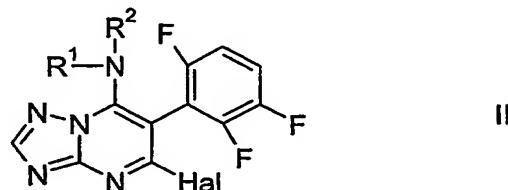
## 9. Verbindungen der Formel I.3,



in der

- 10      D      zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocycl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, (exo)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen und Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkylenoxy tragen kann; und
- 15      X      Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

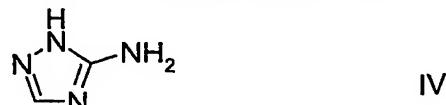
- 20      10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 2, durch Umsetzung von 5-Halogen-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II



in der Hal für ein Halogenatom steht, mit Verbindungen der Formel III

- 25      M-X      in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall-Kation steht und X die Bedeutung gemäß Anspruch 1 hat.

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, durch Umsetzung von 2-Aminotriazol der Formel IV



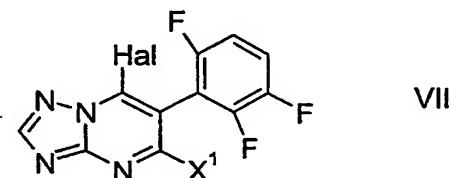
5 mit Ketoestern der Formel V,



in der R und X¹ unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl bedeuten, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidinen der Formel VI,



10 Halogenierung von VI mit Halogenierungsmitteln zu Halogenpyrimidinen der Formel VII,



in der Hal für ein Halogenatom steht, und Umsetzung von VII mit Aminen der Formel VIII,



15 in der R¹ und R² die Bedeutung wie in Formel I haben.

12. Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.

20 13. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 1 bis 1000 g/100 kg

25 14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materia-

**29**

lien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 behandelt.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International Application No PCT/EP2004/014206
---

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> IPC 7 C07D487/04 A01N43/90
--

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 945 453 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 29 September 1999 (1999-09-29) cited in the application Beispiele the whole document	1-14
Y	WO 99/31255 A (GENENCOR INTERNATIONAL, INC; BOWER, BENJAMIN, S; FOWLER, TIMOTHY; PHIL) 24 June 1999 (1999-06-24) Beispiele the whole document	1-14
A	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24 October 2002 (2002-10-24) cited in the application the whole document	1-14
		-/-

Further documents are listed in continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the International filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

1 April 2005

Date of mailing of the International search report

11/04/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**International Application No  
**PCT/EP2004/014206****C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16 May 2002 (2002-05-16) cited in the application the whole document -----	1-14

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014206

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 0945453	A 29-09-1999	AT 239727 T AT 228133 T AU 752669 B2 AU 3098599 A AU 735730 B2 AU 6867198 A BG 64197 B1 BG 103805 A BR 9808531 A BR 9909009 A CA 2287470 A1 CA 2324154 A1 CN 1302299 A ,C CN 1528762 A CZ 20003472 A3 CZ 292092 B6 DE 69814375 D1 DE 69814375 T2 DE 69903988 D1 DE 69903988 T2 DK 975635 T3 DK 945453 T3 EA 2906 B1 EA 3281 B1 EE 9900486 A EP 0975635 A1 EP 0945453 A1 EP 1066291 A1 ES 2188094 T3 HU 0001993 A2 HU 0101751 A2 IL 132238 A JP 11322750 A JP 2001520650 T JP 2003522100 T NO 994973 A NZ 500143 A PL 343176 A1 PT 945453 T SI 975635 T1 SK 141499 A3 WO 9948893 A1 US 6284762 B1 ZA 200005867 A		15-05-2003 15-12-2002 26-09-2002 18-10-1999 12-07-2001 11-11-1998 30-04-2004 30-06-2000 23-05-2000 28-11-2000 22-10-1998 30-09-1999 04-07-2001 15-09-2004 16-01-2002 16-07-2003 12-06-2003 24-12-2003 02-01-2003 27-03-2003 02-06-2003 16-12-2002 31-10-2002 24-04-2003 15-06-2000 02-02-2000 29-09-1999 10-01-2001 16-06-2003 28-10-2000 28-10-2001 29-05-2003 24-11-1999 30-10-2001 22-07-2003 13-10-1999 29-06-2001 30-07-2001 31-03-2003 31-10-2003 11-09-2001 30-09-1999 04-09-2001 22-10-2001
WO 9931255	A 24-06-1999	AU 1726299 A CA 2315017 A1 EP 1038008 A2 JP 2003527065 T NZ 505295 A WO 9931255 A2		05-07-1999 24-06-1999 27-09-2000 16-09-2003 20-12-2002 24-06-1999
WO 02083677	A 24-10-2002	AT 274518 T DE 60201089 D1 DE 60201089 T2 WO 02083677 A1 EP 1381610 A1 JP 2004526767 T		15-09-2004 30-09-2004 30-12-2004 24-10-2002 21-01-2004 02-09-2004

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014206

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
WO 02083677	A	US	2004110751 A1	10-06-2004
WO 0238565	A 16-05-2002	AU WO EP JP US	2183102 A 0238565 A2 1368351 A2 2004513170 T 2004110771 A1	21-05-2002 16-05-2002 10-12-2003 30-04-2004 10-06-2004

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2004/014206

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole )  
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 945 453 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 29. September 1999 (1999-09-29) in der Anmeldung erwähnt Beispiele das ganze Dokument	1-14
Y	WO 99/31255 A (GENENCOR INTERNATIONAL, INC; BOWER, BENJAMIN, S; FOWLER, TIMOTHY; PHIL) 24. Juni 1999 (1999-06-24) Beispiele das ganze Dokument	1-14
A	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-14

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- \*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts
1. April 2005	11/04/2005
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Fritz, M

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**Internationales Aktenzeichen  
**PCT/EP2004/014206****C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002 (2002-05-16) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-14

**INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014206

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0945453	A	29-09-1999		AT 239727 T		15-05-2003
				AT 228133 T		15-12-2002
				AU 752669 B2		26-09-2002
				AU 3098599 A		18-10-1999
				AU 735730 B2		12-07-2001
				AU 6867198 A		11-11-1998
				BG 64197 B1		30-04-2004
				BG 103805 A		30-06-2000
				BR 9808531 A		23-05-2000
				BR 9909009 A		28-11-2000
				CA 2287470 A1		22-10-1998
				CA 2324154 A1		30-09-1999
				CN 1302299 A ,C		04-07-2001
				CN 1528762 A		15-09-2004
				CZ 20003472 A3		16-01-2002
				CZ 292092 B6		16-07-2003
				DE 69814375 D1		12-06-2003
				DE 69814375 T2		24-12-2003
				DE 69903988 D1		02-01-2003
				DE 69903988 T2		27-03-2003
				DK 975635 T3		02-06-2003
				DK 945453 T3		16-12-2002
				EA 2906 B1		31-10-2002
				EA 3281 B1		24-04-2003
				EE 9900486 A		15-06-2000
				EP 0975635 A1		02-02-2000
				EP 0945453 A1		29-09-1999
				EP 1066291 A1		10-01-2001
				ES 2188094 T3		16-06-2003
				HU 0001993 A2		28-10-2000
				HU 0101751 A2		28-10-2001
				IL 132238 A		29-05-2003
				JP 11322750 A		24-11-1999
				JP 2001520650 T		30-10-2001
				JP 2003522100 T		22-07-2003
				NO 994973 A		13-10-1999
				NZ 500143 A		29-06-2001
				PL 343176 A1		30-07-2001
				PT 945453 T		31-03-2003
				SI 975635 T1		31-10-2003
				SK 141499 A3		11-09-2001
				WO 9948893 A1		30-09-1999
				US 6284762 B1		04-09-2001
				ZA 200005867 A		22-10-2001
WO 9931255	A	24-06-1999		AU 1726299 A		05-07-1999
				CA 2315017 A1		24-06-1999
				EP 1038008 A2		27-09-2000
				JP 2003527065 T		16-09-2003
				NZ 505295 A		20-12-2002
				WO 9931255 A2		24-06-1999
WO 02083677	A	24-10-2002		AT 274518 T		15-09-2004
				DE 60201089 D1		30-09-2004
				DE 60201089 T2		30-12-2004
				WO 02083677 A1		24-10-2002
				EP 1381610 A1		21-01-2004
				JP 2004526767 T		02-09-2004

**INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

**PCT/EP2004/014206**

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 02083677	A	US	2004110751 A1	10-06-2004
WO 0238565	A 16-05-2002	AU WO EP JP US	2183102 A 0238565 A2 1368351 A2 2004513170 T 2004110771 A1	21-05-2002 16-05-2002 10-12-2003 30-04-2004 10-06-2004